## **ACRYLONITRILE COMPOUND**

Patent number:

JP2000290279

**Publication date:** 

2000-10-17

Inventor:

MURAKAMI HIROSHI; NUMATA AKIRA; UENO HIDEKI;

MIYAKE TOSHIRO; TAKII SHINJI; ITO TOSHINORI

Applicant:

NISSAN CHEMICAL IND LTD

Classification:

- international:

A01N43/653; C07D401/14; C07D403/06; C07D405/14; A01N43/64; C07D401/00; C07D403/00; C07D405/00;

(IPC1-7): C07D403/06; A01N43/653; C07D401/14;

C07D405/14

- european:

Application number: JP19990100512 19990407 Priority number(s): JP19990100512 19990407

Report a data error here

#### Abstract of JP2000290279

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain a new acrylonitrille compound capable of exhibiting an excellent pest control activity and useful as a new insecticide or a new germicide. SOLUTION: This acrylonitrile compound is represented by formula I (A is a 1-6C alkyl, a 2-6C alkenyl or the like; R1 is H, a 1-12C alkyl, a 2-12C alkenyl or the like; R2 is H, a 1-4C alkyl, a 2-4C alkoxyalkyl or the like; R3 is a 1-4C alkyl, a 2-4C alkenyl, a 1-4C haloalkyl or the like; R4 and R5 are each H, OH, SH, NH2, a halogen, a 1-4C alkyl or the like), e.g. 3-(1,4- dimethylpyrazol-5-yl)-3-hydroxy-2-(1-methyl-3-phenyl-1,2,4-triazol-5-yl)-acrylonitrile. The compound represented by formula I can be obtained by reacting a cyanomethyltriazole derivative represented by formula II with a carboxylic acid derivative represented by formula III (L1 is a leaving group) in the presence of a base and further reacting the resultant compound with a compound represented by formula IV (L2 is a leaving group).

Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide

(19)日本国特許庁 (JP)

(51) Int.Cl.7

識別記号

# (12) 公開特許公報(A)

(11)特許出願公開番号 特開2000-290279

(P2000-290279A)

テーマコート\*(参考)

(43)公開日 平成12年10月17日(2000.10.17)

千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学

最終頁に続く

工業株式会社中央研究所内

(0 -) 1110-04.			
C 0 7 D 403/06		C 0 7 D 403/	/06 4 C 0 6 3
A01N 43/6	53	A01N 43/	/653 L 4H011
C 0 7 D 401/14		C07D 401/	/14
405/1	4	405/	/14
		審査請求	未請求 請求項の数6 OL (全 16 頁)
(21)出願番号	特顧平11-100512	(71)出顧人 (	000003986 日産化学工業株式会社
(22)出顧日	平成11年4月7日(1999.4.7)	,	東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1
		(72)発明者 オ	村上 博
		-	千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学
			工業株式会社中央研究所内
		(72)発明者	褶田 昭
		l l	千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学 工業株式会社中央研究所内
		1	

FΙ

#### (54) 【発明の名称】 アクリロニトリル化合物

(57)【要約】

【課題】 新規な農薬、特に殺虫、殺ダニ剤を提供す

【解決手段】 式(1):

【化1】



[式中、Aはフェニルまたは $C_1 \sim G$  アルキルなどであり、 $R^1$ は $C_1 \sim C_1$ 2 アルキルなどであり、 $R^2$ はH、 $C_1 \sim G$  アルキル、 $C_1 \sim G$  アルキルカルボニルまたは $C_2 \sim G$  アルコキシアルキルなどであり、 $R^3$ は $C_1 \sim G$  アルキルなどであり、 $R^4$  及び $R^5$ はH、Nロゲン、 $C_1 \sim G$  アルキルなどである。] で表されるアクリロニトリル化合物。

【特許請求の範囲】 【請求項1】 式(1):

【化1】

A N OR Z R'3

1

[式中、AはC1~C6アルキル、C2~C6アルケニル、C1~C6ハロアルキル、C1~C4アルキルで置換されていてもよいC3~C7シクロアルキル、Xで置換されていてもよいフェニル、ナフチルまたはビリジニルであり、

 $R^1$ はH、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_1 \sim C_{12}$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルで置換されていてもよい  $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル、 $C_2 \sim C_{12}$  アルキルスルフェニル アルキル、 $C_2 \sim C_{12}$  アルキルスルフォニルアルキル、 $C_2 \sim C_{12}$  アルキルスルフォニルアルキル、 $C_2 \sim C_{12}$  アルキルスルフォニルアルキル、 $C_2 \sim C_{12}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{12}$  アルキル、 $C_3 \sim C_{12}$  アルキル、 $C_4 \sim C_{12}$  アルキル、 $C_5 \sim C_{12}$  アルキル、 $C_6 \sim C_{12}$  アルキル・ $C_6 \sim C_{12}$  アルキル、 $C_6 \sim C_{12}$  アルキル、 $C_6 \sim C_{12}$  アルキル・ $C_6 \sim C_{12}$  アルキル・ $C_6 \sim C_{12}$  アルキル・ $C_6 \sim C_{12}$  アルキル・ $C_6 \sim C_6$  アルキル

R<sup>2</sup>はH、C<sub>1</sub>~G アルキル、C<sub>2</sub>~G アルコキシアルキル、C 20 H<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>OC<sub>2</sub>H<sub>4</sub>OCH<sub>3</sub>、RcもしくはRdで置換されたC<sub>1</sub>~ C<sub>4</sub>アルキル、テトラヒドロピラニル、トリメチルシリル、SO<sub>2</sub>Re、SO<sub>2</sub>NHRb、SO<sub>2</sub>NRaRb、C(S)NHRb、C(S)NRaR b、CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Ra、C(0)Rf、P(0)RgRh、P(S)RgRh、アルカリ金属、アルカリ土類金属またはNHRiRjRkであり、

Xはハロゲン、C1~C1アルキル、C2~C1アルケニル、C1 ~Gハロアルキル、G~Gアルコキシ、G~Gハロアル コキシ、C1~C4アルコキシアルキル、C1~C4アルキルス ルフェニル、C1~Gアルキルスルフィニル、C1~Gアル キルスルフォニル、C1~Gハロアルキルスルフェニル、 C1~Gハロアルキルスルフィニル、C1~Gハロアルキル スルフォニル、NO2、CN、フェニルおよびフェノキシの 中から任意に選ばれる1ないし3個の置換基であり、 R<sup>t</sup>およびR<sup>6</sup>は各々独立にH、OH、SH、NH2、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~C4アルキル、C2~C4アルケニル、C1~C4ハロアルキ ル、C1~Gアルコキシ、C1~Gハロアルコキシ、C1~G アルコキシアルキル、Ci~Ci アルキルスルフェニル、Ci ~Caアルキルスルフィニル、Ca~Caアルキルスルフォニ ル、 $C_1 \sim C_1 \cap C_1 \cap C_2 \cap C_3 \cap C_4 \cap C_4 \cap C_4 \cap C_5 \cap C_6 \cap C$ キルスルフィニル、G~Gハロアルキルスルフォニル、 NO2またはCNであり、

R³はC1~G アルキル、C2~G アルケニル、C1~G ハロアルキルまたはC1~G アルコキシアルキルであり、RaはC1~G アルキルであり、

RbdtH、C1~Gs アルキルまたはT1で置換されていてもよいフェニルであり、

Rcはハロゲン、C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub> アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>3</sub> アルケニル、C<sub>1</sub> ~C<sub>4</sub> ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> ハロアル コキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルコキシアルキルの中から任意に選ば れる1種以上で置換されていてもよいフェニルであり、 Rdはハロゲン、C1〜Gアルキル、C2〜Gアルケニル、C1〜Gハロアルキル、C1〜Gアルコキシ、C1〜Gハロアルコキシ、C1〜Gアルコキシアルキルの中から任意に選ばれる1種以上で置換されてもよいベンゾイルであり、ReはC1〜Gアルキル、C2〜Gアルケニル、C1〜GハロアルキルまたはT1で置換されていてもよいフェニルであり、

RfはCi~Caアルキル、C2~Caアルケニル、C1~Caハロアルキル、C2~Caアルコキシアルキル、C3~Caハロシクロフルキル、Rcで置換されたCi~Caアルキル、C1~Caアルキルで置換されたいてもよいC3~Ciシクロアルキル、RcおよびC1~Caアルキルで置換されたシクロプロピル、Rc及びハロゲンで置換されたC3~Caシクロアルキル、T²およびC1~Caアルキルで置換されたシクロプロピル、Rcで置換されたC2~Caアルケニル、C1~Caアルコキシ、C1~Caアルカーシ、C2~Caアルケニルオキシ、C1~Caアルキルで置換されていてもよいC3~Caシクロアルコキシ、ベンジルオキシ、CDORa、-NU¹U²、T³で置換されていてもよいフェニル、ナフチル、T¹で置換されてもよいフェニル、ナフチル、T¹で置換されてもよいフェニル、ナフチル、T¹で置換されてもよいフェニル、ナフチル、T²で置換されてもよいフェニル、ナフチル、T²で置換されてもよい

Rg及びRhは各々独立に、OH、C1~C6アルキル、C1~C6アルコキシまたはC1~C4アルキルスルフェニルであり、Ri、Rj及びRkは各々独立に、H、フェニル、C1~C6アルキル、C1~C4アルケニル、C1~C4アルケニルオキシ、C1~C4アルケニルオキシ、C1~C4アルケニルオキシ、C1~C4アルケニルオキシ、C1~C4アルケニルオキシ、C1~C4アルケニルオキシ、C4~C4アルケニルオキシ、C4のではではベンジルであるか、あるいはRi、Rj及びRkのうちの2個が、それぞれが結合している窒素原子と共に酸素原子、窒素原子または硫黄原子を含有していてもよい5ないし8員環基を形成してもよく、

30 Tlは、ハロゲン、Cl~G アルキル、Cl~G ハロアルキル またはCl~G アルコキシであり、

下は、ハロゲンで置換されていてもよいC2~G アルケニルであり、

『は、ハロゲン、 $C_1 \sim G$  アルキル、 $C_1 \sim G$  ハロアルキル、 $C_1 \sim G$  アルコキシ、 $C_1 \sim G$  ハロアルコキシ、 $C_1 \sim G$  アルキルスフェニル、 $C_1 \sim G$  アルキルスフォニル、 $C_1 \sim G$  ハロアルキルスフェニル、 $C_1 \sim G$  ハロアルキルスフェニル、 $C_1 \sim G$  ハロアルキルスフェニル、 $C_1 \sim G$  ハロアルキルスフィニル、 $C_1 \sim G$  ハロアルキルスルフォニル、 $C_2 \sim G$  、CHO、 $-NU U^2$ 、フェニル及びフェノキシの中から任意に選ばれる 1 ないし 5 個の置換基であり、

⊮および№は、各々独立に、H、C1~C3アルキル、COOR a、フェニルまたはベンジルを表すか、あるいはψとゆとが結合している窒素原子とともに酸素原子、窒素原子または硫黄原子を含有していてもよい5ないし8員環基を形成してもよい。]で表されるアクリロニトリル化合物。

【請求項2】 Aはフェニルであり、 RiはCi~Ceアルキルであり、

50 R2はHまたはC(O)Rfであり、

R³はCı~Csアルキルであり、

R<sup>4</sup>はH、ハロゲン、C<sub>1</sub>〜G。アルキルまたはC<sub>1</sub>〜G。アルコキシであり、

R5はHまたはC1~C6アルキルであり、

RflaC1~Csアルキルである請求項1記載のアクリロニトリル化合物。

【請求項3】 R<sup>1</sup> はメチルまたはノルマルヘキシルであり、

R3はメチルであり、

R\*はH、塩素原子、メチルまたはメトキシであり、

R⁵はH、メチルまたはエチルであり、

Rfはターシャリーブチルである請求項2記載のアクリロニトリル化合物。

【請求項4】 Aはフェニルであり、

R1はC1~C6アルキルであり、

R2はHまたはC(O)Rfであり、

R3はC1~Coアルキルであり、

R4はH、ハロゲンまたはC1~C6アルキルであり、

R5はHまたはC1~C6アルキルであり、

RfはC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルである請求項1記載のアクリロニト 20 リル化合物。

【請求項5】 R<sup>1</sup>はメチルまたはノルマルヘキシルであり、

R3はメチルであり、

RfはH、塩素原子またはメチルであり、

R5はHまたはメチルであり、

Rfはターシャリーブチルである請求項4記載のアクリロニトリル化合物。

【請求項6】請求項1~5記載のアクリロニトリル化合物の1種以上を有効成分として含有することを特徴とす 30 る農薬。

【発明の詳細な説明】

[0001]

【発明の属する技術分野】本発明は、新規なアクリロニトリル化合物ならびに該化合物を有効成分として含有することを特徴とする農薬に関するものである。本発明における農薬とは、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤及び殺菌剤などであり、特に農園芸、畜産、衛生分野の殺虫剤、殺ダニ剤及び殺線虫剤である。

[0002]

【従来の技術】農薬としてのアクリロニトリル誘導体に 関しては、W097/40009、W098/42683に記載がある。

[0003]

【発明が解決しようとする課題】殺虫剤や殺菌剤の長年にわたる使用により、近年、病害虫が抵抗性を獲得し、従来の殺虫剤や殺菌剤による防除が困難になっている。よって本発明の課題は、優れた有害生物防除活性を示す新規な殺虫剤や殺菌剤を提供することにある。

[0004]

【課題を解決するための手段】本発明者らは、上記の課 50 ルコキシアルキルであり、

題を解決するために研究を続けた結果、下記の化合物が 優れた有害生物防除活性を示すことを見出し本発明を完成した。

【0005】すなわち本発明は、下記〔1〕~〔5〕に 記載の化合物(以下、本発明化合物と称す。)及び下記 〔6〕に記載の該化合物を有効成分として含有する農薬 に関するものである。

【0006】[1] 式(1):

[0007]

10 【化2】

【0008】 [式中、AはC1~Csアルキル、C2~Csアル ケニル、C1~Gハロアルキル、C1~Gアルキルで置換さ れていてもよいC3~C7シクロアルキル、Xで置換されて いてもよいフェニル、ナフチルまたはピリジニルであ り、R1はH、C1~C12アルキル、C2~C12アルケニル、C1 ~C12ハロアルキル、C1~Gアルキルで置換されていて もよいC3~C7シクロアルキル、C2~C12アルキルスルフ ェニルアルキル、C2~C12アルキルスルフィニルアルキ ル、C2~C12アルキルスルフォニルアルキル、C2~C12ア ルコキシアルキル、フェニルで置換されたC1~C3アルキ ル、Xで置換されていてもよいフェニル、COORa、CONHR b、CONRaRb、CORaまたはCO(N-ピペリジニル)であり、R2 はH、C1~C4アルキル、C2~C4アルコキシアルキル、CH2 SCH3、CH2OC2H4OCH3、RcもしくはRdで置換されたC1~C4 アルキル、テトラヒドロピラニル、トリメチルシリル、 SO<sub>2</sub>Re, SO<sub>2</sub>NHRb, SO<sub>2</sub>NRaRb, C(S)NHRb, C(S)NRaRb, CH<sub>2</sub> CO<sub>2</sub>Ra、C(0)Rf、P(0)RgRh、P(S)RgRh、アルカリ金属、 アルカリ土類金属またはNHRiRjRkであり、

【0009】Xはハロゲン、Ci~Ciアルキル、Ci~Gア ルケニル、C1~Gハロアルキル、C1~Gアルコキシ、C1 ~Gハロアルコキシ、C1~Gアルコキシアルキル、C1~ G アルキルスルフェニル、C1~G アルキルスルフィニ ル、C1~C4アルキルスルフォニル、C1~C4ハロアルキル スルフェニル、C1~C4ハロアルキルスルフィニル、C1~ Gハロアルキルスルフォニル、ND2、CN、フェニルおよ 40 びフェノキシの中から任意に選ばれる1ないし3個の置 換基であり、P⁴およびP5は各々独立にH、OH、SH、NH2、 **ハロゲン、C1~C4アルキル、C2~C4アルケニル、C1~C4** ハロアルキル、C1~Gアルコキシ、G~Gハロアルコキ シ、C1~Gアルコキシアルキル、C1~Gアルキルスルフ ェニル、C1~Gアルキルスルフィニル、C1~Gアルキル スルフォニル、C1~C4ハロアルキルスルフェニル、C1~ Gハロアルキルスルフィニル、CI~Gハロアルキルスル フォニル、NO2またはCNであり、R3はC1~C4アルキル、C 2~C4アルケニル、C1~C4ハロアルキルまたはC1~C4ア

【0010】RaはCi~Csアルキルであり、RbはH、Ci~C 6アルキルまたはT1で置換されていてもよいフェニルで あり、Rcはハロゲン、C1~C4アルキル、C2~Gアルケニ ル、C1~Gハロアルキル、C1~Gアルコキシ、C1~Gハ ロアルコキシ、C1~Gアルコキシアルキルの中から任意 に選ばれる1種以上で置換されていてもよいフェニルで あり、Rdはハロゲン、C1~C1 アルキル、C2~C1 アルケニ ル、C1~Gハロアルキル、C1~Gアルコキシ、C1~Gハ ロアルコキシ、C1~Gアルコキシアルキルの中から任意 に選ばれる1種以上で置換されてもよいベンゾイルであ 10 り、ReはC1~Gアルキル、C2~Gアルケニル、C1~Gハ ロアルキルまたはTiで置換されていてもよいフェニルで あり.

【0011】RfはC1~C6アルキル、C2~C6アルケニル、 C1~C6ハロアルキル、C2~C4アルコキシアルキル、C3~ Coハロシクロアルキル、Rcで置換されたCi~Gアルキ ル、C1~Gアルキルで置換されていてもよいC3~C7シク ロアルキル、RcおよびC1~C1 アルキルで置換されたシク ロプロビル、Rc及びハロゲンで置換されたG~Gシクロ アルキル、T<sup>2</sup>およびC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルで置換されたシクロ 20 プロピル、Rcで置換されたC2~Gアルケニル、C1~Gア ルコキシ、C1~Gハロアルコキシ、C2~Gアルケニルオ キシ、G~Gアルキルで置換されていてもよいG~Gシ クロアルコキシ、ベンジルオキシ、COORa、-NUI U2、T3 で置換されていてもよいフェニル、ナフチル、T1で置換 されてもよいピリジニルまたはフェニル(1~6)アルキル であり、Rg及びRhは各々独立に、DH、C1~C6アルキル、 C1~C6アルコキシまたはC1~Gアルキルスルフェニルで あり、

【OO12】Ri、Rj及びRkは各々独立に、H、フェニ ル、C1~C6アルキル、C1~C4アルケニル、C1~C4アルケ ニルオキシ、CI~C3アルキルで置換されていてもよいC3 ~Coシクロアルキルまたはベンジルであるか、あるいは Ri、Rj及びRkのうちの2個が、それぞれが結合している 窒素原子と共に酸素原子、窒素原子または硫黄原子を含 有していてもよい5ないし8員環基を形成してもよく、 Tiは、ハロゲン、Ci~Gアルキル、Ci~Gハロアルキル またはCi~Ciアルコキシであり、T2は、ハロゲンで置換 されていてもよいC2~Gアルケニルであり、

【0013】T3は、ハロゲン、C1~Gアルキル、C1~G 40 ハロアルキル、C1~Gアルコキシ、C1~Gハロアルコキ シ、C1~Gアルキルスフェニル、C1~C4アルキルスフィ ニル、C1~Gアルキルスフォニル、C1~Gハロアルキル スフェニル、C1~Gハロアルキルスフィニル、C1~Gハ ロアルキルスルフォニル、NO2、CN、CHO、-NU1 U2、フェ ニル及びフェノキシの中から任意に選ばれる1ないし5 個の置換基であり、UIおよびUIは、各々独立に、H、CI ~Ceアルキル、COORa、フェニルまたはベンジルを表す か、あるいはいといとが結合している窒素原子とともに 酸素原子、窒素原子または硫黄原子を含有していてもよ 50 リ土類金属、NHRiRjRk。R2II:H、C1~C1アルキル、C2

い5ないし8員環基を形成してもよい。] で表されるア ` クリロニトリル化合物。

【0014】 [2] Aはフェニルであり、R1はC1~G アルキルであり、R2はHまたはC(O)Rfであり、R3はC1~C 6アルキルであり、R⁴はH、ハロゲン、C1~C6アルキルま たはC1~C6アルコキシであり、R5はHまたはC1~C6アル キルであり、RfはCi~Gアルキルである上記〔1〕記載 のアクリロニトリル化合物。

【0015】[3] R1はメチルまたはノルマルヘキシ ルであり、R3はメチルであり、R4はH、塩素原子、メチ ルまたはメトキシであり、R5はH、メチルまたはエチル であり、Rfはターシャリーブチルである上記〔2〕記載 のアクリロニトリル化合物。

【0016】〔4〕 Aはフェニルであり、R1はC1~G アルキルであり、R2はHまたはC(O)Rfであり、R3はC1~C 6アルキルであり、R⁴はH、ハロゲンまたはC1~C6アルキ ルであり、RoはHまたはC1~C6アルキルであり、RfはC1 ~Gアルキルである上記〔1〕記載のアクリロニトリル 化合物。

【0017】[5] R1はメチルまたはノルマルヘキシ ルであり、R³はメチルであり、R⁴はH、塩素原子または メチルであり、R5はHまたはメチルであり、Rfはターシ ャリーブチルである上記〔4〕記載のアクリロニトリル 化合物。

【0018】(6)上記(1)~(5)記載のアクリロ ニトリル化合物の1種以上を有効成分として含有するこ とを特徴とする農薬。

#### [0019]

【発明の実施の形態】本発明化合物(1)の-C(C 30 N) = C(OR $^2$ ) - 部は、R $^2$ が水素原子以外の場合 にE体及びZ体の2種の異性体が存在するが、両者とも 本発明に含まれる。また、R<sup>2</sup>が水素原子の場合には互 変異性体が存在するが、これらも本発明に含まれる。 【0020】次にA、R1、R2、R3、R4、R5、X、Ra、Rb、 Rc, Rd, Re, Rf, Rg, Rh, Ri, Rj, Rk, T1, T2, T3, U1 及びU2の好ましい範囲を説明する.

【0021】好ましいAの範囲は以下に示す群である。 即ち、AI: C1~C6アルキル、Xで置換されていてもよい フェニル、ナフチルまたはピリジニル。AII: G~Gア ルキル、Xで置換されていてもよいフェニル。

【0022】好ましいRIの範囲は以下に示す群である。  $R^{1}1:H$ ,  $C_{1}\sim C_{1}2$  P $\nu$ + $\nu$ ,  $C_{2}\sim C_{1}2$  P $\nu$ + $\nu$ + $\nu$ 2 $\nu$ 7 $\nu$ = $\Gamma$ ルアルキル、C2~C12アルコキシアルキル、フェニルで 置換されたC1~C3アルキル。R1 I1: H、C1~C12アルキ

【0023】好ましいR2の範囲は以下に示す群である。 **R<sup>2</sup>I:H、C1∼Gアルキル、C2∼Gアルコキシアルキル、** CH2OC2H4OCH3, SO2Re, SO2NHRb, SO2NRaRb, C(S)NHRb, C(S) NRaRb、CH2 CO2 Ra、C(O) Rf、アルカリ金属、アルカ

~Gアルコキシアルキル、 $SO_2Re$ 、C(0)Rf、アルカリ金属、アルカリ土類金属、 $NHRiR_jRk$ 。 $R^2III: H、<math>C_1$ ~Gアルキル、 $C_2$ ~Gアルコキシアルキル、 $SO_2Re$ 、C(0)Rf。 【OO24】好ましい $R^3$ の範囲は以下に示す群である。  $R^3I: C_1$ ~Gアルキル、 $C_1$ ~Gアルコキシアルキル。 $R^3I: C_1$ ~Gアルキル。

【0025】好ましい $R^4$ の範囲は以下に示す群である。  $R^4$ I:H、CH、SH、NH2、NDゲン、 $C_1$ ~ $C_4$ アルキル、 $C_1$ ~ $C_4$ アルコキシ、 $C_1$ ~ $C_4$ アルコキシ、 $C_1$ ~ $C_4$ アルコキシアルキル。 $R^4$ II:H、CH、NDゲン、 $C_1$ ~ $C_4$ アルキル。

【0027】好ましいXの範囲は以下に示す群である。 即ち、XI:ハロゲン、Ci~Ca アルキル、Ci~Ca ハロアルキル、Ci~Ca アルコキシ及びフェニルの中から任意に選ばれる1ないし3個の置換基。XII:ハロゲン、Ci~Ca アルキル、Ci~Ca アルコキシ及びフェニルの中から任意に選ばれる1ないし2個の置換基。

【0028】好ましいRaの範囲は以下に示す群である。 即ち、RaI: C1~Gアルキル。

【0029】好ましいRbの範囲は以下に示す群である。 即ち、Rb1: C1~Ceアルキル、T1で置換されていてもよ いフェニル。

【0030】好ましいRcの範囲は以下に示す群である。 即ち、RcI:ハロゲン、Ci~Gアルキル、Ci~Gアルコ キシで置換されていてもよいフェニル。

【0031】好ましい、Rdの範囲は以下に示す群である。即ち、RdI:ハロゲン、C1~C4アルキルで置換されていてもよいベンゾイル。

【0032】好ましいReの範囲は以下に示す群である。 即ち、ReI:  $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $\Gamma_1$  で置換されていてもよいフェニル。

【0033】好ましいRfの範囲は以下に示す群である。即ち、RfI: C1~Ccアルキル、C2~Ccアルケニル、C1~Ccアルキル、C1~Ccアルコキシアルキル、C1~Ccアルコキシ、C2~Ccシクロアルキル、C1~Ccアルコキシ、C3~Ccシクロアルコキシ、T3で置換されていてもよいフェニル。RfII: C1~Ccアルキル、C1~Ccアルキルで置換されていてもよいC3~Ccシクロアルキル、C1~Ccアルキルで置換されていてもよいC3~Ccシクロアルキル、C1~Ccアルコキシ、T3で置換されていてもよいフェニル。

【0034】好ましいRgの範囲は以下に示す群である。 即ち、 $Rg1:OH、C1\sim Ce$  アルコキシまたは $C1\sim Cq$  アルキルスルフェニル。

【0035】好ましいRhの範囲は以下に示す群である。

即ち、RhI: C1~Cg アルコキシ、C1~Cg アルキルスルフェニル。

【0036】好ましいRiの範囲は以下に示す群である。 即ち、RiI:H、Ci~Caアルキル、Ca~Caシクロアルキル またはベンジルであるか、あるいはRiとRjが、それぞれ が結合している窒素原子と共に酸素原子、窒素原子もし くは硫黄原子を含有していてもよい5ないし6員環基を 形成してもよい。

【0037】好ましいRjの範囲は以下に示す群である。 10 即ち、RjI: H、Ci~Ceアルキル、Ca~Ceシクロアルキル またはベンジルであるか、あるいはRiとRjが、それぞれ が結合している窒素原子と共に酸素原子、窒素原子もし くは硫黄原子を含有していてもよい5ないし6員環基を 形成してもよい。

【0038】好ましいRkの範囲は以下に示す群である。 即ち、Rk1:H、C1~C6アルキル。

【0039】好ましいUの範囲は以下に示す群である。 即ち、UI:H、C1~Csアルキル、COORa、フェニルまた はベンジル。

【0040】好ましいI<sup>1</sup>の範囲は以下に示す群である。即ち、I<sup>1</sup>1:H、C1~C6アルキル、COORa、フェニルまたはベンジル。

【0041】好ましい $T^1$ の範囲は以下に示す群である。 即ち、 $T^1$ 1:ハロゲン、 $C_1$ ~Gアルキル、 $C_1$ ~Gハロアルキル。

【0042】好ましい「『の範囲は以下に示す群である。 即ち、「『1:ハロゲン、C1~G アルキル、C1~Gハロア ルキル、C1~G アルコキシ、C1~Gハロアルコキシ、C1 ~G アルキルスルフェニル、C1~G アルキルスルフィニ 30 ル、C1~G アルキルスルフォニル、一NU『『の中から任意に選ばれる1ないし3個の置換基。「『II:ハロゲン、C1~G アルキル、C1~G アルコキシの中から任意に選ばれる1ないし3個の置換基。

【0043】上述の好ましい置換基の範囲における各群はそれぞれ任意に組み合わせる事ができる。

【OO44】次にA、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、X、Ra、Rb、Rc、Rd、Re、Rf、Rg、Rh、Ri、Rj、Rk、T<sup>1</sup>、T<sup>2</sup>、T<sup>3</sup>、U<sup>1</sup>及びU<sup>2</sup>の定義における各原子および基の例を示す。

【0045】R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、X、Rc、Rd、T<sup>1</sup>、T<sup>2</sup>及びT<sup>3</sup>の定義 におけるハロゲン原子としては、フッ衆原子、塩素原 子、臭索原子及びヨウ素原子があげられ、好ましくはフ ッ衆原子、塩素原子及び臭素原子があげられる。

【0046】A、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、X、Ra、Rb、Rc、Rd、Re、Rf、Rg、Rh、Ri、Rj、Rk、T¹、T³、U¹及びU²の定義におけるアルキルとしては、直鎖または分岐状のアルキルとしてメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソプチル、tert-ブチル、sec-ブチル、ペンチル-1、ペンチル-2、ペンチル-3、2-メチルブチル-1、2-メチルブチル-3、3-メチルブチル-1、2-メチルブチル-3、3-メチ

50 ルブチルー1,2,2-ジメチルプロピルー1、ヘキシルー1、ヘ

キシル-2、ヘキシル-3、1-メチルペンチル、2-メチルペ ンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1,1-ジ メチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチ ル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジ メチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1,1, 2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル及び1-エチル-2-メチルプロピ ル等があげられ、各々の指定の炭素数の範囲で選択され る。

[0047] A, R<sup>1</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, X, Rc, Rd, Re, Rf, T1及びT3の定義におけるハロアルキルとしては、直鎖ま たは分岐状のハロアルキルとしてフルオロメチル、クロ ロメチル、ブロモメチル、フルオロエチル、クロロエチ ル、プロモエチル、フルオロ-n-プロピル、クロロ-n-プ ロヒル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、 トリフルオロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチ ル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、トリクロ ロエチル、クロロジフルオロメチル、ブロモジフルオロ メチル、トリフルオロクロロエチル、ヘキサフルオロー -プロビル、クロロブチル及びフルオロブチル等があげ られ、各々の指定の炭素数の範囲から選択される。

【0048】A、R1、Rf、Ri、Rj及びRkの定義における シクロアルキルとしては、シクロプロピル、1-メチルシ クロプロピル、2,2,3,3-テトラメチルシクロプロピル、 シクロプチル、1-エチルシクロプチル、1-n-ブチルシク ロブチル、シクロペンチル、1-メチルシクロペンチル、 シクロヘキシル、1-メチルシクロヘキシル及び4-メチル シクロヘキシル、シクロヘプチル等があげられる。

【0049】Rfの定義におけるBcで置換されたCi~Gア モベンジル、4-クロロベンジル、4-メチルベンジル、4tert-ブチルベンジル、2-メチルベンジル、2-メトキシ ベンジル、1-フェニルエチル、1-(3-クロロフェニル)エ チル、2-フェニルエチル、1-メチル-1-フェニルエチ ル、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-(3-クロ ロフェニル)-1-メチルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、3-フェニルプロピル、1-フェニルブ チル、2-フェニルブチル、3-フェニルブチル、4-フェニ ルブチル、1-メチル-1-フェニルプロピル、1-メチル-2-フェニルプロピル、1-メチル-3-フェニルプロピル、2-メチル-2-フェニルプロピル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチループロビル及び2-メチル-2-(3-メチルフェニル)-プロピル等があげられる.

【0050】Rb及びReの定義におけるT<sup>1</sup>で置換されてい てもよいフェニルとしては、フェニル、2-フルオロフェ ニル、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、2-ク ロロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、 2-プロモフェニル、3-プロモフェニル、4-プロモフェニ ル、4-ヨードフェニル、2,4-ジクロロフェニル、3,4-ジ

ロフェニル、2-フルオロ-4-クロロフェニル、2,3,4,5,6 ーペンタフルオロフェニル、2-メチルフェニル、3-メチ ルフェニル、4-メチルフェニル、2,5-ジメチルフェニ ル、4-メチル-2,3,5,6-テトラフルオロフェニル、2-メ トキシフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェ ニル、2,6-メトキシフェニル、3,4-ジメトキシフェニル 及び3,4,5-トリメトキシフェニル、2-トリフルオロメチ ルフェニル、3-トリフルオロメチルフェニル、4-トリフ ルオロメチルフェニル等があげられる。

1.0

10 【0051】R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、X、Rc、Rd、Rf、Rg、Rh、T<sup>1</sup>及UT 3の定義におけるアルコキシとしては、直鎖または分岐 鎖状のアルコキシとしてメトキシ、エトキシ、n-プロボ キシ、イソプロポキシ、n-ブトキシ、イソブトキシ、se c-ブトキシ、tert-ブトキシ、n-ペンチルオキシ、1-メ チルブチルオキシ、2-メチルブチルオキシ、3-メチルブ チルオキシ、1,1-ジメチルプロポキシ、1,2-ジメチルプ ロポキシ、2,2-ジメチルプロポキシ、1-エチルプロピル オキシ、n-ヘキシルオキシ、1-メチルペンチルオキシ、 2-メチルペンチルオキシ、3-メチルペンチルオキシ、4-メチルペンチルオキシ、1,1-ジメチルブチルオキシ、1, 2-ジメチルプチルオキシ、1,3-ジメチルプチルオキシ、 2.2-ジメチルブチルオキシ基、2,3-ジメチルブチルオキ シ基、3,3-ジメチルブチルオキシ、1-エチルブチルオキ シ、2-エチルブチルオキシ、1,1,2-トリメチルプロピル オキシ、1,2,2-トリメチルプロピルオキシ、1-エチル-1 -メチルプロピルオキシ及び1-エチル-2-メチルプロピル オキシ等があげられ、各々の指定の炭素数の範囲から選 択される.

【0052】Rf及びT3の定義における-NUIU2としては ルキルとしては、ベンジル、2-クロロベンジル、3-ブロ 30 メチルアミノ、エチルアミノ、n-プロピルアミノ、イソ プロピルアミノ、n-ブチルアミノ、イソブチルアミノ、 sec-ブチルアミノ、tert-ブチルアミノ、n-ペンチルア ミノ、1-メチルブチルアミノ、2-メチルブチルアミノ、 3-メチルブチルアミノ、1,1-ジメチルプロピルアミノ、 1,2-ジメチルプロピルアミノ、2,2-ジメチルプロピルア ミノ、1-エチルプロピルアミノ、n-ヘキシルアミノ、1-メチルペンチルアミノ、2-メチルペンチルアミノ、3-メ チルペンチルアミノ、4-メチルペンチルアミノ、1,1-ジ メチルブチルアミノ、1,2-ジメチルブチルアミノ、1,3-- ジメチルブチルアミノ、2,2-ジメチルブチルアミノ、2, 3-ジメチルブチルアミノ、3,3-ジメチルブチルアミノ、 1-エチルブチルアミノ、2-エチルブチルアミノ、1,1,2-トリメチルプロピルアミノ、1,2,2-トリメチルプロピル アミノ、1-エチル-1-メチルプロピルアミノ、ジメチル アミノ、ジエチルアミノ、ジ-n-プロピルアミノ、ジイ ソプロピルアミノ、ジ-n-ブチルアミノ、ジ-sec-ブチル アミノ、ジイソブチルアミノ、ジ-n-ペンチルアミノ、 ジ-n-ヘキシルアミノ、メチルエチルアミノ、メチルプ ロビルアミノ、メチルイソプロビルアミノ、メチルブチ クロロフェニル、2,6-ジフルオロフェニル、2,6-ジクロ 50 ルアミノ、メチル-sec-ブチルアミノ、メチルイソブチ

ルアミノ、メチルーtert-ブチルアミノ、メチルペンチルアミノ、メチルヘキシルアミノ、エチルプロピルアミノ、エチルイソプロピルアミノ、エチルブチルアミノ、エチルーsec-ブチルアミノ、エチルイソブチルアミノ、エチルペンチルアミノ、エチルヘキシルアミノ、フェニルアミノ、ベンジルアミノ、N-メチルアセトアミドN-アセチルアセトアミド等があげられ、各々の指定の炭素数の範囲で選択される。

【0053】R<sup>4</sup>、R<sup>6</sup>、X, Rc、Rd、Rf及びT<sup>3</sup>の定義にお 10 けるハロアルコキシとしては、各々直鎖状または分岐鎖状のハロアルコキシがあげられ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ブロモジフルオロメトキシ、グロロメトキシ、グロロメトキシ、ブロモメトキシ、ブロエトキシ、ブロエトキシ、ブロエトキシ、ブロエトキシ、ドリフルオロエトキシ、ドリフルオロエトキシ、トリフルオロエトキシ、トリフルオロエトキシ、カロロエトキシ、ブロオロプロボキシ、ブローブロボキシ、ブロモアロボキシ、フルオロブトキシ、クロロブトキシ、ブロモアロボキシ、フルオロブトキシ、クロコブトキシ、フルオローiso-プロボキシ等があげられる。

【0054】 $R^1$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、X、Rg、 $Rh及びT^3$ の定義におけるアルキルスルフェニルとしては、メチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、iso-プロピルチオ、n-ブチルチオ、iso-ブチルチオ、gec-ブチルチオ及びfert-ブチルチオ等があげられる。

【0055】R¹、R⁴、R⁵、X及びT³の定義におけるアルキルスルフィニルとしては、メチルスルフィニル、エチ 30ルスルフィニル、nープロピルスルフィニル、iso-プロピルスルフィニル、nーブチルスルフィニル、iso-ブチルスルフィニル、sec-ブチルスルフィニルをびtert-ブチルスルフィニル等があげられる。

【0056】R¹、R²、R²、X及びT²の定義におけるアルキルスルフォニルとしては、メチルスルフォニル、エチルスルフォニル、iso-プロピルスルフォニル、iso-プロピルスルフォニル、iso-ブチルスルフォニル、sec-ブチルスルフォニル及びtert-ブチルスルフォニル等があげられる。

【0057】R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、X、Rc、Rd及びRfの 定義におけるアルコキシアルキルとしては、メトキシメ チルメチル、エトキシメチル、n-プロボキシメチル、is o-プロボキシメチル、n-ブトキシメチル、iso-ブトキシ メチル、sec-ブトキシメチル、tert-ブトキシメチル、n -ペンチルオキシメチル、メトキシエチル、エトキシメ チル及びメトキシプロピル等があげられ、各々指定の炭 素数の範囲から選択される。

【0058】A及びRfの定義におけるナフチルとしては1-ナフチル及び2-ナフチルがあげられる。

【0059】 № の定義における「「で置換されていてもよいとリジニルとしては、「「で置換されていてもよい2ーピリジル、「「で置換されていてもよい3ーピリジル及び「「で置換されていてもよい4ーピリジルがあげられ、好ましくは「「で置換されていてもよい2ーピリジルであり、より好ましくは「「で置換されていてもよい3ーピリジルである。

12

【0060】 R\*、R5、X及びT³の定義におけるハロアルキルスルフェニルとしては、直鎖状または分岐鎖状のハロアルキルチルチオとしてフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、ブロモジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリクロロメチルチオ、2,2,2-トリフルオロエチルチオ、1,1,2,2-テトラフルオロエチルチオ、フルオロエチルチオ、ペンタフルオロエチルチオ及びフルオローiso-プロピルチオ基等があげられる。

【0061】R\*、R5、X及びT³の定義におけるハロアルキルスルフィニルとしては、直鎖状または分岐鎖状のハロアルキルスルフィニルとしてフルオロメチルスルフィニル、ブロモジンルオロメチルスルフィニル、ブロモジンルオロメチルスルフィニル、トリフロロメチルスルフィニル、トリクロロメチルスルフィニル、2,2,2-トリフルオロエチルスルフィニル、1,1,2,2-テトラフルオロエチルスルフィニル、フルオロエチルスルフィニル、ベンタフルオロエチルスルフィニルをびフルオローiso-プロビルスルフィニルなどがあげられる。

【0062】 M、R®、X及びT®の定義におけるハロアルキルスルフォニルとしては、直鎖状または分岐鎖状のハロアルキルスルフォニルとしてフルオロメチルスルフォニル、ブロモジフルオロメチルスルフォニル、トリクロロジチルスルフォニル、トリクロロメチルスルフォニル、2,2,2-トリフルオロエチルスルフォニル、フルオロエチルスルフォニル、ベンタフルオロエチルスルフォニル及びフルオローiso-プロビルスルフォニル等があげられる。

【0063】Rf、Ri、Rj、Rkの定義におけるアルケニル オキシとしては、C2~Ci 直鎖または分岐状のアルケニル オキシとしてアリルオキシ、2-プロペニルオキシ、2-ブ テニルオキシ及び2-メチル-2-プロペニルオキシ等があ 40 げられる。

【0064】A、R<sup>1</sup>、X、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、Ri、Ri及びRkの定義におけるアルケニルとしては、アリル、2-プロペニル、2-ブテニル、2-メチル-2-プロペニル、4-メチル-3-ペンテニル、2-ヘキセニル等があげられ、各々指定の炭素数で選択される。

【0065】R<sup>2</sup>の定義におけるアルカリ金属としてはリチウム、ナトリウム、カリウムがあげられる。

【0066】R<sup>2</sup>の定義におけるアルカリ土類金属として は、マグネシウム、カルシウム、ストロンチウムまたは 50 パリウムがあげられ、好ましくはマグネシウム、カルシ ウムまたはバリウムがあげられる.

【0067】R2の定義におけるNHRiRjRkで示されるアン モニウム基としては、アンモニウム基、モノメチルアン モニウム基、ジメチルアンモニウム基、トリメチルアン モニウム基、ジェチルアンモニウム基、トリエチルアン モニウム基、ジイソプロピルアンモニウム基、ジイソプ ロビルエチルアンモニウム基、ヘキシルメチルアンモニ ウム基、シクロプロピルメチルアンモニウム基、シクロ ヘキシルメチルアンモニウム基、アリルメチルアンモニ ウム基、ベンジルメチルアンモニウム基または4-メチル 10 シクロヘキシルエチルアンモニウム基であるか、あるい はRi、Rj及びRkのうちの2個がそれぞれが結合している 窒素原子とともに酸素原子、窒素原子もしくは硫黄原子 を含有してよい複素環式5員環、6員環、7員環または 8員環アンモニウム基等があげられる。

【0068】Ri、Rj及びRkの定義におけるRi、Rj及びRk のうちの2個がそれぞれが結合している窒素原子ととも に酸素原子、窒素原子もしくは硫黄原子を含有していて もよい複素環式5ないし8員環アンモニウム基として は、ピロリジン、ピラゾリジン、イミダゾリジン、オキ 20 -ジメチル-3-フェニルシクロプロピル基、(4-ブロモフ サゾリジン、イソオキサゾリジン、チアゾリジン、ピペ リジン、ピペラジン、モルホリン、チアモルホリン、ヘ キサメチレンイミン、ヘプタメチレンイミンがあげられ

【0069】い及びいの定義におけるいといとが結合し ている窒素原子とともに酸素原子、窒素原子もしくは硫 黄原子を含有していてもよい複素環式5ないし8員環と しては、ピロリジン、ピラゾリジン、イミダゾリジン、 オキサゾリジン、イソオキサゾリジン、チアゾリジン、 ピペリジン、ピペラジン、モルホリン、チアモルホリ ン、ヘキサメチレンイミン、ヘプタメチレンイミンがあ げられる.

【0070】Rfの定義におけるCa~Caハロシクロアルキ ルとしては、フルオロシクロプロピル、ジフルオロシク ロプロピル、クロロシクロプロピル、ジクロロシクロプ ロピル、1-メチル-2,2-ジクロロシクロプロピル、クロ ロシクロブチル、ジクロロシクロブチル、クロロシクロ ペンチル、ジクロロシクロペンチル、クロロシクロヘキ シル、ジクロロシクロヘキシル、テトラフルオロシクロ ブチルなどがあげられる。

【0071】Rfの定義におけるT<sup>2</sup>及びC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルで 置換されたシクロプロビルとしては、2,2-ジメチル-3-(2.2-ジメチルエテニル)-シクロプロピル、3-(2.2-ジブ ロモエテニル)-2,2-ジメチルシクロプロピル、3-(2,2-ジクロロエテニル)-2,2-ジメチルシクロプロピル、3-(2,2-クロロトリフルオロエテニル)-2,2-ジメチルシク ロプロピル等があげられる。

【0072】Rfの定義におけるCi~Ciアルキルで置換さ れていてもよいC3~C3シクロアルコキシ基としては、シ

14 シ基、シクロヘキシルオキシ基、1-メチルシクロプロピ キシ基等があげられる。

【0073】Rfの定義におけるRc及びハロゲン原子で置 換されたG~Gシクロアルキルとしては、2,2-ジクロロ -1-フェニルシクロプロピル、2,2-ジクロロ-1-(3-クロ ロフェニル)-シクロプロピル、2,2-ジクロロ-1-(4-メト キシフェニル)-シクロプロピル、2,2-ジクロロ-1-(4-エ トキシフェニル)-シクロプロピル、2,2-ジクロロ-1-(4iso-プロピルオキシフェニル)-シクロプロピル、2,2-ジ クロロ-1-(4--t-ブチルフェニル)-シクロプロピル、 2,2-ジクロロ-1-(4-メトキシフェニル)-3-フェニルシク ロプロピル、1-(4-エトキシフェニル)-2,2,3,3-テトラ フルオロブチル等があげられる。

【0074】Rfの定義におけるRcと炭素数1~4のアル キル基で置換されたシクロプロピル基としては、2.2-ジ メチル-1-フェニルシクロプロピル基、1-(4-クロロフェ ニル)-2,2-ジメチルシクロプロピル基、2,2-ジメチル-3 -フェニルシクロプロピル基、3-(3-クロロフェニル)-2, 2-ジメチルシクロプロピル基、(4-クロロフェニル)-2,2 ェニル)-2,2-ジメチル-3-フェニルシクロプロピル基、 2,2-ジメチル-3-(4-メチルフェニル)-シクロプロピル 基、(4-tert-ブチルフェニル)-2,2-ジメチル-3-フェニ ルシクロプロピル基等があげられる。

【0075】Rfの定義におけるRcで置換されたG~Gシ クロアルキルとしては、1-フェニルシクロプロピル、1-(3-クロロフェニル)-シクロプロピル、1-(4-クロロフェ ニル)-シクロプロピル、1-(4-ブロモフェニル)-シクロ プロピル、1-(4-フルオロフェニル)-シクロプロピル、1 30 -(4-エチルフェニル)-シクロプロピル、1-(4-プロピル フェニル)-シクロプロピル、2-フェニルシクロプロピ ル、1-フェニルシクロブチル、2-フェニルシクロブチ ル、1-フェニルシクロペンチル、1-(4-クロロフェニル) -シクロペンチル、2-フェニルシクロペンチル、3-フェ ニルシクロペンチル、1-フェニルシクロヘキシル、1-(3 -フルオロフェニル)-シクロヘキシル、1-(4-クロロフェ ニル)-シクロヘキシル1-(4-tert-ブチルフェニル)-シク ロヘキシル、2-フェニルシクロヘキシル、3-フェニルシ クロヘキシル、4-フェニルシクロヘキシル等があげられ 40 る.

\_【0076】本発明化合物は、農園芸作物及び樹木など を加害するいわゆる農業害虫、家畜家禽類に寄生するい わゆる家畜害虫、家屋等の人間の生活環境で様々な悪影 響を与えるいわゆる衛生害虫、倉庫に貯蔵された穀物等 を加害するいわゆる貯穀害虫、及び同様の場面で発生加 害するダニ類、線虫類、軟体動物、甲殻類のいずれの害 虫も低濃度で有効に防除できる。

【0077】本発明化合物を用いて防除しうる昆虫類、 ダニ類、線虫類、軟体動物及び甲殻類には具体的には次 クロプロボキシ基、シクロブトキシ基、シクロペントキ 50 に示すものがあるが、それらのみに限定されるものでは ない。

【0078】 ニカメイガ、コブノメイガ、フタオビコヤ ガ、イチモンジセセリ、コナガ、ヨトウガ、モンシロチ ョウ、カブラヤガ、ハスモンヨトウ、シロイチモンジヨ トウ、チャノコカクモンハマキ、チャハマキ、モモシン クイ、ナシヒメシンクイ、リンゴコカクモンハマキ、キ ンモンホソガ、コットンボールワーム、タバコバッドワ ーム、ヨーロピアンコーンボーラー、フォールアーミー ワーム、コドリンガ及びアメリカシロヒトリなどの鱗翅 アブラムシ、ワタアブラムシ、オンシツコナジラミ、タ バココナジラミ、ナシキジラミ、ツツジグンバイ、ヤノ ネカイガラムシ、クワコナカイガラムシ、ルビーロウム シ、クサギカメムシ、ナガメ及びナンキンムシなどの半 翅目客虫、ニジュウヤホシテントウ、ドウガネブイブ イ、イネミズゾウムシ、アリモドキゾウムシ、ウリハム シ、キスジノミハムシ、コロラドハムシ、ゴマダラカミ キリ、マツノマダラカミキリ、コーンルートワーム、コ コクゾウ、グラナリーウィービル及びコクヌストモドキ などの鞘翅目害虫、

【0079】マメハモグリバエ、タネバエ、ヘシアンフ ライ、ウリミバエ、チチュウカイミバエ、イエバエ、サ シバエ、ヒツジシラミバエ、キスジウシバエ、ウシバ エ、ヒツジバエ、ツェッツェバエ、アカイエカ、ネッタ イシマカ及びハマダラカなどの双翅目害虫、カブラハバ チ、マツノキハバチ及びクリハバチなどの膜翅目害虫、 ミナミキイロアザミウマ、ネギアザミウマ、ミカンキイ ロアザミウマ、ヒラズハナアザミウマ及びチャノキイロ アザミウマなどの総翅目害虫、クロゴキブリ、ヤマトゴ キブリ及びチャバネゴキブリなどの網翅目客虫、トノサ 30 マバッタ、コバネイナゴ及びサバクワタリバッタなどの 直翅目害虫、イエシロアリ、ヤマトシロアリ及びタイワ ンシロアリなどのシロアリ目害虫、ネコノミ、ヒトノミ 及びケオプスネズミノミなどの等翅目害虫、ニワトリオ オハジラミ及びウシハジラミなどのハジラミ目害虫、ウ シジラミ、ブタジラミ、ウシホソジラミ及びケブカウシ ジラミなどのシラミ目害虫、ミカンハダニ、リンゴハダ ニ、ナミハダニ及びカンザワハダニなどのハダニ類、 【0080】ミカンサビダニ、ニセナシサビダニ、チュ ーリップサビダニ及びチャノナガサビダニなどのフシダ 二類、チャノホコリダニ及びシクラメンホコリダニなど のホコリダニ類、ケナガコナダニ及びロビンネダニなど のコナダニ類、ミツバチヘギイタダニなどのハチダニ 類、オウシマダニ及びフタトゲチマダニなどのキュウセ ンダニ類、ヒゼンダニなどのヒゼンダニ類、サツマイモ ネコブセンチュウ、キタネコブセンチュウ、キタネグサ レセンチュウ、クルミネグサレセンチュウ、ジャガイモ シストセンチュウ及びマツノザイセンチュウなどの線虫 類、スクミリンゴガイ、ナメクジ、ウスカワマイマイ及

の甲殻類などがあげられる。

【0081】すなわち、本発明化合物は直翅目、半翅 目、鱗翅目、鞘翅目、膜翅目、双翅目、シロアリ目及び ダニ・シラミ類の害虫や植物病害を低濃度で有効に防除 できる。一方、本発明化合物はホ乳類、魚類、甲殼類及 び益虫に対してほとんど悪影響がない極めて有用な化合 物を含む。

【0082】本発明化合物(1)は、スキーム1に記載 した方法によって合成できる。即ち本発明化合物(1) 目害虫、ツマグロヨコバイ、トビイロウンカ、モモアカ 10 は、一般式(2)で表されるシアノメチルトリアゾール 誘導体と一般式(3)で表されるカルボン酸誘導体とを 塩基存在下で反応させることにより本発明化合物の一部 を合成することができ、更にこれを一般式(4)で表さ れる化合物と反応させることにより本発明化合物が得ら れることを表す。一般式(4)で表される化合物は、具 体的にはアシルハライド類、ベンゾイルハライド類、ア ルキルハライド類、ベンジルハライド類、アルコキシア ルキルハライド類、アルコキシアルコキシアルキルハラ イド類、フェノキシアルキルハライド類、ベンジルオキ 20 シアルキルハライド類、アルキルスルフォネート類、ベ ンゼンスルフォネート類、トルエンスルフォネート類、 α-ハロケトン類及びα-ハロエステル類等である。

[スキーム1]

[0083]

【0084】 [スキーム1中のA、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びR 5は前記と同じ意味を表し、い及び12は良好な脱離基、 例えば塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、C1~G アルキ ルスルフォニルオキシ、ベンゼンスルフォニルオキシ、 40 トルエンスルフォニルオキシ、1-イミダゾリル及び1 - ピラゾリル等である。].

【0085】上記に記載した方法は塩基を用いたほうが 好ましい場合もある。用いられる塩基としてはナトリウ ムエトキシド、ナトリウムメトキシド及びtert-ブトキ シカリウム等のアルカリ金属アルコキシド類、水酸化ナ トリウム及び水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化 物、炭酸ナトリウム及び炭酸カリウム等のアルカリ金属 炭酸塩、トリエチルアミン、ピリジン及びDBU等の有機 塩基、ブチルリチウム等の有機リチウム化合物、リチウ びミスジマイマイなどの軟体動物、オカダンゴムシなど 50 ムジイソプロプロピルアミド及びリチウムビストリメチ

ルシリルアミド等のリチウムアミド類並びに水素化ナト リウム等が挙げられる。

【0086】上記に記載した反応は、反応に不活性な溶 媒中で行う事ができ、溶媒としてはメタノール及びエタ ノール等の低級アルコール類、ベンゼン及びトルエン等 の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロ フラン、1,4-ジオキサン、1,2-ジメトキシエタン及び1, 2-ジェトキシェタン等のエーテル類、アセトン、メチル エチルケトン及びメチルイソブチルケトン等のケトン 類、塩化メチレン、クロロホルム及び1,2-ジクロロエタ 10 ン等のハロゲン化炭化水素類、ジメチルホルムアミド、 ジメチルアセトアミド及び1,3-ジメチルイミダゾリジノ ン等のアミド類、アセトニトリル等のニトリル類、ジメ チルスルホキシド並びにこれらの混合溶媒等が挙げられ る。場合によっては、これらの溶媒と水との混合溶媒も 用いる事ができ、テトラ-n-ブチルアンモニウムブロマ イド等の4級アンモニウム塩を触媒として添加する事に より好結果が得られる場合もある。反応温度は−70℃ から200℃の任意の温度に設定する事が可能であり、 0℃から150℃または溶媒を用いる場合には-70℃ 20 から溶媒の沸点の範囲が好ましい。塩基は反応基質の 0.05から10当量を、好ましくは0.05から3当 量の範囲である。

【0087】本発明化合物は常法により反応液から得る ことができるが、本発明化合物を精製する必要が生じた 場合には再結晶、カラムクロマトグラフィー等の任意の 精製法によって分離、精製することができる。

【0088】なお、本発明に包含される化合物の中で不 斉炭素を有する化合物の場合には、光学活性な化合物 (+)体及び(-)体が含まれる。

【0089】本発明に含まれる化合物の例を第1表に示す。尚、表中の略号はそれぞれ以下の意味を示す。

【0090】Me:メチル基、Et:エチル基、Pr:プロピル基、Bu:ブチル基、Pen:ペンチル基、Hex:ヘキシル基、Hep:ヘプチル基、Oct:オクチル基、Non:ノニル基、Dec:デシル基、Ph:フェニル基、n:ノルマル、i:イソ、s:セカンダリー、t:ターシャリー、c:シクロ

【0091】〔第1表〕

[0092]

【化4】

【0093】 【表1】

COtEn

[0094]

【表2】

<u>د</u>	r 	r 	K		K.
Pb	l.	CO t Ba	<b>K</b> e	1	cr.
Pb	I.	COtBu	Hc.	CF.	E.
Ph	Le	COtBu	<b>E</b> c	X e	CP.
РЬ	1e	COtBa	Le	CF.	Ee.
Le	I.	CO t Ba	He .	C1	n
ā.	1.	COt Bu	E:	1.	ı.
Et	1e	COtBo	le:	It	C1
Et	I e	CO t Bu	<b>K</b> e	It	Xe.
oPro	Le	COtBu	No.	I e	Cl
aPr•	Le	CO t Bu	E:	I.	K.
iPro	I e	COtBu	Ile	X:	Cl
iPro	Ie	COtBu	Le	Be:	Ke
aBu	I.	COtBo	Xe	I.	£1
aBu	1:	COtBu	Le	X:	Ec.
i Bu	I e	COtBu	Ee .	H:	Cl
iBu	1 c	COt Bu	lie .	J:	Ec
eBu	Te .	COtBo	Ľ.	ı.	C1
s Bu	I.	COtBa	Ec.	ı.	Le
tBu	Se	COtBa	H:	X:	C1
tBu	i e	COtBu	lle .	Χŧ	Le
Ph	It	COt Bo	x.	z,	£.
Ph	aPro	CO t Bu	Le	X.	Ec.
<b>?</b> h	iPro	COtBu	He .	Ic	Ile

【0095】 【表3】

40

Δ	r	E*	K*	r	£*
Ph	s Bu	COtBu		ı.	L:
Ph	i Bu	CO t Ba	ll:	I.	E.
7h	s Bu	COtBu	11c	Xe.	E¢.
Ph	t Ba	COtBu	ı.	1:	Ec.
Pb	.Pen	CO t Bu	E:	Re	E.
Pb	eOc t	CO t Ba	E.	ı.	E.
fh	allon	COtBa	ile:	At	Ee
Pb	aDec	COt Bu	lle .	Re	Ee.
Ph	cPro	CO t Bu	L	1.	Ee.
Ph	e Pen	COtBu	Ec.	N:	Ee.
Ph	cHex	COtBu	<b>E</b> e	X:	Re
Ph	c Hep	COt Bu	lle .	No.	Ee.
Ph	1.	COLe	R.	1.	1e
Ph	1.	COE t	He.	I.	I.
Fh	1e	11c	<b>H</b> e	1:	le .
Ph	1e	Et	Ne.	T.	le .
Ph	le	<b>50.≣e</b>	E:	I.	I.
Ph	le	SO.Mic.	Ha .	3.	E:
Ph	I e	COTTLe	1c	Ne .	Le .
Ph	le	CO- (2-C1)-	Ph. Me	l:	1c
Ph	1.	CO- (3-C1)-	Ph Bo	z.	E.
Ph	1.	m- (4-01)-	Ph Be	1.	I.

## [0096]

ľ	表	4	1
۰	<b>~</b> 、		-

1	r	a.	<b>K</b> .	ĸ	ĸ
ъ Р	· le	CO t Bu	nP:o	1.	£e
ъ	Ec.	CO t Bu	iPro	Rc	Ec.
'h	£c.	CO t Ba	nB v	Re	Le
'h	le .	COt Bu	iBr	N:	Le
'h	i.	CO t Bu	sB u	Xe	I.
'h	I.	COt Bu	tB s	x.	L,
'b	E e	COt Bu	Ie	Et	Ec
'b	Ic	COt Bu	1e	nFro	C:
ъ	I.	CO t Bu	le .	iPro	l.
'h	Ie	CO t Bu	He .	nlu	Ec
'h	Le	CO t Bu	R:	íðo	Re
'h	Ie	COt Bu	l.	s3a	le
ъ	1e	COt Bu	He .	t So	ı.
<b>'</b> ь	Ie	COtBu	<b>L</b> e	ı.	Et
ъ	1e	CO tBu	<b>B</b> c	Xe.	nPre
'n	I e	CO t Bu	Le	le .	iPre
ъ	La	COtBu	L	E.	n Bu
'ь	ı.	COtBu	1e	K:	i Bu
b	le .	COtBu	1e	H.e	e Du
ъ	<b>I</b> c	COtBu	I:	<b>L</b> e	t Bu

【0097】本発明化合物を審虫防除剤として施用するにあたっては、通常適当な固体担体又は液体担体と混合し、更に所望により界面活性剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、結合剤、固結防止剤、崩壊剤および分解防止剤等を添加して、液剤、乳剤、水和剤、水溶剤、顆粒水和剤、顆粒水溶剤、懸濁剤、乳濁剤、サスボエマルジョン、マイクロエマルジョン、粉剤、粒剤およびゲル剤等任意の剤型の製剤にて実用に供することができる。

意の剤型の製剤を水溶性包装体に封入して供することも できる。

【0098】固体担体としては、例えば石英、カオリナイト、パイロフィライト、セリサイト、タルク、ベントナイト、酸性白土、アタバルジャイト、ゼオライトおよび珪藻土等の天然鉱物質類、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウムおよび塩化カリウム等の無機塩類、合成珪酸ならびに合成珪酸塩が挙げられる。

【0099】液体担体としては、例えばエチレングリコ 10 ール、プロピレングリコールおよびイソプロパノール等のアルコール類、キシレン、アルキルベンゼンおよびアルキルナフタレン等の芳香族炭化水素類、ブチルセロソルブ等のエーテル類、シクロヘキサノン等のケトン類、アーブチロラクトン等のエステル類、Nーメチルピロリドン、Nーオクチルピロリドン等の酸アミド類、大豆油、ナタネ油、綿実油およびヒマシ油等の植物油ならびに水が挙げられる。

【0100】これら固体および液体担体は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

20 【0101】界面活性剤としては、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ボリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル、ボリオキシエチレンボリオキシプロピレンブロックコポリマー、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステルおよびポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル等のノニオン性界面活性剤、アルキル硫酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸
30 塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、ア

5 塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、ボリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸および燐酸塩、ボリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル硫酸および燐酸塩、ボリカルボン酸塩およびボリスチレンスルホン酸塩等のアニオン性界面活性剤、アルキルアミン塩およびアルキル4級アンモニウム塩等のカチオン性界面活性剤ならびにアミノ酸型およびベタイン型等の両性界面活性剤が挙げられる。

【0102】これら界面活性剤の含有量は、特に限定さ40 れるものではないが、本発明の製剤100重量部に対し、通常0.05~20重量部の範囲が望ましい。また、これら界面活性剤は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

【0103】また、本発明化合物を農薬として使用する場合には必要に応じて製剤時または散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤、共力剤、肥料、土壌改良剤などと混合施用しても良い。

ル剤等任意の剤型の製剤にて実用に供することができ 【0104】特に他の農薬あるいは植物ホルモンと混合 る。また、省力化および安全性向上の観点から、上記任 50 施用することにより、施用薬量の減少による低コスト

化、混合薬剤の相乗作用による殺虫スペクトラムの拡大 や、より高い有害生物防除効果が期待できる。この際、 同時に複数の公知農薬との組み合わせも可能である。本 発明化合物と混合使用する農薬の種類としては、例え ば、ファーム・ケミカルズ・ハンドブック (Farm Chemicals Handbook) 1994年版 に記載されている化合物などがある。具体的にその一般 名を例示すれば次の通りであるが、必ずしもこれらのみ に限定されるものではない。

【0105】殺菌剤: アシベンゾラール (acibenzola r)、アムプロピルホス (ampropyfos)、アニラジン (a nilazine)、アザコナゾール (azaconazole)、アゾキ シストロビン (azoxystrobin)、ベナラキシル (benala xyl)、ベノダニル (benodanil)、ベノミル (benomy 1)、ベンザマクリル (benzamacril)、ビナパクリル (binapacryl)、ビフェニル (biphenyl)、ビテルタノ ール (bitertanol)、ベトキサジン (bethoxazine)、 ボルドー液 (bordeaux mixture)、ブラストサイジンー S (blasticidin-S)、プロモコナゾール (bromoconazol e)、ブピリメート (bupirimate)、ブチオベート (but 20 hiobate)、カルシウムポリスルフィド (calcium polys ulfide)、キャプタフォール(captafol)、キャプタン (captan)、カッパーオキシクロリド (copper oxychlo ride)、カルプロパミド (carpropamid)、カルベンダ ジン (carbendazim)、カルボキシン (carboxin)、キ ノメチオネート (chinomethionat)、クロベンチアゾン (chlobenthiazone)、クロルフェナゾール (chlorfena zol)、クロロネブ (chloroneb)、クロロタロニル (ch lorothalonil)、クロゾリネート (chlozolinate)、ク フラネブ (cufraneb)、

【0106】シモキサニル(cymoxanil)、シプロコナ ゾール (cyproconazol)、シプロジニル (cyprodini 1)、シプロフラム (cyprofuram)、デバカルブ (debac arb)、ジクロロフェン (dichlorophen)、ジクロブト ラゾール (diclobutrazol)、ジクロフラニド (diclhlo fluanid)、ジクロメジン (diclomedine)、ジクロラン (dicloran)、ジエトフェンカルブ (diethofencar b)、ジクロシメット(diclocymet)、ジフェノコナゾ ール (difenoconazole)、ジフルメトリン (diflumetor im)、ジメチリモール (dimethirimol)、

【0107】ジメトモルフ (dimethomorph)、ジニコナ ゾール (diniconazole)、ジニコナゾールーM (dinicon azole-M)、ジノカップ (dinocap)、ジフェニルアミン (diphenylamine)、ジピリチオン(dipyrithione)、 ジタリムホス (ditalimfos)、ジチアノン (dithiano n)、ドデモルフ (dodemorph)、ドジン (dodine)、ド ラゾクソロン (drazoxolon)、エデフェノホス (edifen phos)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、エタ コナゾール (etaconazole)、エチリモル (ethirimo 1)、エトリジアノール (etridiazole)、ファモキサゾ 50 キシフェン (quinoxyfen)、キントゼン (quintozen

ン (famoxadone)、フェナリモル (fenarimol)、フェ ブコナゾール (febuconazole)、フェンフラム (fenfur

【0108】フェンピクロニル (fenpiclonil)、フェ ンプロピジン (fenpropidin)、フェンプロピモルフ (f enpropimorph)、フェンチン (fentin)、フェルバン (ferbam)、フェリムゾン (ferimzone)、フルアジナ ム (fluazinam)、フルジオキソニル (fludioxonil)、 フルオロイミド (fluoroimide)、ブルキンコナゾール (fluquinconazole)、フルシラゾール (flusilazol e)、フルスルファミド (flusulfamide)、フルトラニ ル (flutolanil)、フルトリアフォール (flutriafo 1)、フォルペット(folpet)、フォセチルーアルミニ ウム (fosetyl-aluminium)、フベリダゾール (fuberid azole)、フララキシル (furalaxyl)、フェナミドン (fenamidone)、フェンヘキサミド (fenhexamid)、 【0109】グアザチン (guazatine)、ヘキサクロロ ベンゼン (hexachlorobenzene)、ヘキサコナゾール(h exaconazole)、ヒメキサゾール(hymexazol)、イマザ リル (imazalil)、イミベンコナゾール (imibenconazo le)、イミノクタジン (iminoctadine)、イプコナゾー ル (ipconazole)、イプロベンホス (iprobenfos)、イ プロジオン (iprodione)、イソプロチオラン (isoprot hiolane)、イプロバリカルブ (iprovalicarb)、 【0110】カスガマイシン(kasugamycin)、クレソ キシム-メチル (kresoxim-methyl)、マンカッパー(m ancopper)、マンコゼブ (mancozeb)、マンネブ (mane b)、メパニピリム (mepanipyrim)、メプロニル (mepr onil)、メタラキシル (metalaxyl)、メトコナゾール (metconazole)、メチラム (metiram)、メトミノスト ロビン (metominostrobin) 、ミクロブタニル (myclobu tanil)、ナバム (nabam)、ニッケルビス (ジメチルジ チオカーバメート) (nickel bis(dimethyldithiocarba mate))、ニトロタールーイソプロピル (nitrothal-iso propyl)、ヌアリモル (nuarimol)、オクチリノン (oc thilinone)、オフレース (ofurace)、オキサジキシル (oxadixyl)、オキシカルボキシン (oxycarboxin)、 オキポコナゾールフマール酸塩(oxpoconazole fumarat e).

【0111】ペフラゾエート (pefurzoate)、ペンコナ ゾール (penconazole)、ペンシクロン (pencycuro n)、フタライド (phthalide) 、ピペラリン (piperali n)、ポリオキシン (polyoxins)、プロベナゾール (pr obenazole)、プロクロラズ (prochloraz)、プロシミ ドン(procymidone)、プロパモカルブ塩酸塩(propamo carb hydrochloride)、プロピコナゾール (propiconaz ole)、プロピネブ (propineb)、ピラゾホス (pyrazop hos)、ピリフェノックス (pyrifenox)、ピリメタニル (pyrimethanil)、ピロキュロン (pyroquilon)、キノ

e) 、

【0112】硫黄 (sulfur)、スピロキサミン (spirox amine)、テプコナゾール(tebuconazole)、テクナゼ ン (tecnazene)、テトラコナゾール (tetraconazol e)、チアベンダゾール (thi abendazole)、チフルザミ ド (thifluzamide)、チオファネートーメチル (thioph anate-methyl)、チラム(thiram)、トルクロホスーメ チル (tolclofos-methyl)、トリルフラニド (tolylflu anid)、トリアジメホン (triadimefon)、トリアジメ ノール (toriadimenol)、トリアゾキシド (triazoxid e)、トリシクラゾール(tricyclazole)、トリデモル フ (tridemorph)、トリフルミゾール (triflumizol e)、トリホリン(triforine)、トリチコナゾール(tr iticonazole)、バリダマイシン (validamycin)、ピン クロゾリン (vinclozolin)、ジネブ (zineb) 及びジラ ム (ziram) など。

【0113】殺バクテリア剤:ストレプトマイシン (st reptomycin)、オキシテトラサイクリン (oxyterracycl ine) 及びオキソリニックアシド (oxolinic acid) な ど.

【0114】殺線虫剤:アルドキシカルブ (aldoxycar b)、フォスチアゼート (fosthiazate)、フォスチエタ ン (fosthietan)、オキサミル (oxamyl) 及びフェナミ ホス (fenamiphos) など。

【0115】殺ダニ剤: アミトラズ (amitraz)、ブロ モプロピレート (bromopropylate)、チノメチオネート (chinomethionat)、クロロベンジラート (chlorobezi late)、クロフェンテジン (clofentezine)、サイヘキ サチン (cyhexatine)、ジコフォール (dicofol)、ジ エノクロール (dienochlor)、エトキサゾール (etoxaz 30 ole)、フェナザキン (fenazaquin)、フェンブタチン オキシド (fenbutatin oxide) 、フェンプロパトリン (fenpropathrin)、フェンプロキシメート (fenproxim ate)、ハルフェンプロックス (halfenprox)、ヘキシ チアゾックス (hexythiazox) 、ミルベメクチン (milbe mectin)、プロパルギット (propargite)、ピリダベン (pyridaben)、ピリミジフェン (pyrimidifen) 及びテ ブフェンピラド (tebufenpyrad) など。

【0116】殺虫剤:アバメクチン(abamectin)、ア セフェート (acephate)、アセタミピリド (acetamipir 40 lure)、ニテンピラム (nitenpyram)、オメトエート id)、アジンホスーメチル (azinphos-methyl)、ベン ジオカルブ (bendiocarb)、ベンフラカルブ (benfurac arb)、ベンスルタップ(bensultap)、ピフェントリン (bifenthrin)、ブプロフェジン(buprofezin)、ブト カルボキシン (butocarboxim)、カルバリル (carbary 1)、カルボフラン (carbofuran)、カルボスルファン (carbosulfan)、カルタップ (cartap)、クロルフェ ナピル (chlorfenapyr)、クロルピリホス (chlorpyrif os)、クロルフェンビンホス (chlorfenvinphos)、ク ロルフルアズロン (chlorfluazuron)、クロチアニジン 50 nofos)、ピメトロジン (pymetrozine)、ピラクロホス

(clothianidin)、クロマフェノジド (chromafenozid e)、クロビリホスーメチル (chlorpyrifos-methyl)、 シフルトリン (cyfluthrin)、ベーターシフルトリン (beta-cyfluthrin)、シベルメトリン (cypermethri n)、シロマジン (cyromazine)、

【0117】シハロトリン (cyhalothrin) 、ラムダー シハロトリン (lambda-cyhalothrin)、デルタメトリン (deltamethrin)、ジアフェンチウロン (diafenthiuro n)、ダイアジノン (diazinon)、ジアクロデン (diacl 10 oden)、ジフルベンズロン (diflubenzuron)、ジメチ ルピンホス (dimethylvinphos)、ジオフェノラン (dio fenolan)、ジスルフォトン (disulfoton)、ジメトエ ート (dimethoate)、EPN、エスフェンバレレート (esf envalerate)、エチオフェンカルブ (ethiofencarb)、 エチプロール (ethiprole)、エトフェンプロックス (e tofenprox)、エトリムホス (etrimfos)、フェニトロ チオン (fenitrothion)、フェノブカルブ (fenobucar b)、フェノキシカーブ (fenoxycarb)、フェンプロパ トリン (fenpropathrin)、フェンバレレート (fenvale 20 rate)、フィプロニル (fipronil)、フルシトリネート (flucythrinate)、フルフェノクスウロン (flufenoxu ron)、フルフェンプロックス(flufenprox)、タウー フルバリネート (tau-fluvalinate)、ホノホス (fonop hos)、フォルメタネート (formetanate)、フォルモチ オン (formothion)、フラチオカルブ (furathiocar ь),

【0118】ハロフェノジド (halofenozide)、ヘキサ フルムロン (hexaflumuron)、ヒドラメチルノン (hydr amethylnon)、イミダクロプリド (imidacloprid)、イ ソフェンホス (isofenphos)、インドキサカルブ (indo xacarb)、イソプロカルブ (isoprocarb)、イソキサチ オン (isoxathion)、ルフェヌウロン (lufenuron)、 マラチオン (malathion)、メタルデヒド (metaldehyd e)、メタミドホス (methamidophos)、メチダチオン (methidathion)、メタクリホス (methacrifos)、メ タルカルブ (metalcarb)、メソミル (methomyl)、メ ソプレン (methoprene)、メトキシクロール (methoxyc hlor)、メトキシフェノジド (methoxyfenozide)、モ ノクロトホス (monocrotophos) 、ムスカルーレ (musca (omethoate)、オキシデメトンーメチル (oxydemetonmethyl)、オキサミル(oxamyl)、

【0119】パラチオン (parathion)、パラチオンー メチル (parathion-methyl)、ペルメトリン (permethr in)、フェントエート (phenthoate)、フォキシム (ph oxim)、ホレート (phorate)、ホサロン (phosalon e)、ホスメット (phosmet)、ホスファミドン (phosph amidon)、ピリミカルブ (pirimicarb)、ピリミホスー メチル (pirimiphos-methyl)、プロフェノホス (profe

(pyraclofos)、ピリプロキシフェン (pyriproxyfe n)、ロテノン (rotenone)、スルプロホス (sulprofo s)、シラフルオフェン (silafluofen)、スピノサド (spinosad)、スルホテップ(sulfotep)、テブフェノ ジド (tebfenozide)、テフルベンズロン (teflubenzur on)、テフルトリン (tefluthrin)、テルブホス (terb ufos)、テトラクロロビンホス (tetrachlorvinpho s)、チオジカルブ(thiodicarb)、チアメトキサム(t hiamethoxam)、チオファノックス(thiofanox)、チオ メトン (thiometon)、トルフェンピラド (tolfenpyra 10 d)、トラロメスリン(tralomethrin)、トリクロルホ ン (trichlorfon)、トリアズロン (triazuron)、トリ フルムロン (triflumuron) 及びバミドチオン (vamidot hion) など、

【0120】本発明化合物の施用薬量は適用場面、施用 時期、施用方法、栽培作物等により差異はあるが一般に は有効成分量としてヘクタール(ha)当たり0.00 5~50kg程度が適当である。

【0121】次に具体的に本発明化合物を用いる場合の 製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これらの 20 みに限定されるものではない。なお、以下の配合例にお いて「部」は重量部を意味する。

0.1~80部

#### 【0122】〔水和剤〕

本発明化合物

5~98.9部 固体担体 界面活性剤 1~10部 その他 0~ 5部 その他として、例えば固結防止剤、分解防止剤等があげ れらる。 【0123】(乳 剤) 本発明化合物 0.1~30部 液体担体 45~95部

界面活性剤 4.9~15部 その他 0~10部

その他として、例えば展着剤、分解防止剤等が挙げられ

## 【0124】〔懸濁剤〕

本発明化合物 0.1~70部 液体担体 15~98.89部 界面活性剤 1~12部 その他 0.01~30部 その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤等が挙げられ

## 【0125】〔顆粒水和剤〕

本発明化合物 0.1~90部 固体担体 0~98.9部 界面活性剤 1~20部 その他 0~ 10部 その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられ 【0126】〔液 剤〕

本発明化合物 0.01~70部 液体担体 20~99.99部 その他 0~10部 その他として、例えば凍結防止剤、展着剤等が挙げられ

26

【0127】〔粒 剤〕

本発明化合物 0.01~80部 固体担体 10~99.99部 その他 0~10部

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられ

#### 【0128】〔粉 剤〕

本発明化合物 0.01~30部 固体担体 65~99.99部 その他 0~5部

その他として、例えばドリフト防止剤、分解防止剤等が 挙げられる。

【0129】〔製剤例〕次に、本発明化合物を有効成分 とする有害生物防除剤の具体的な製剤例を示すが、本発 明はこれらに限定されるものではない。

【0130】尚、以下の製剤例において、「部」は重量 部を意味する。

### 【0131】〔配合例1〕水和剤

本発明化合物No.2 20部 パイロフィライト 76部 ソルポール5039 2部 (非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混 合物:東邦化学工業(株)商品名)

30 カープレックス#80D 2部

(合成含水珪酸:塩野義製薬(株)商品名) 以上を均一に混合粉砕して水和剤とする。

【0132】[配合例2]乳 剤

本発明化合物No.2 5部 キシレン 75部 Nーメチルピロリドン 15部 ソルポール2680 5部

(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混

25部

合物: 東邦化学工業(株) 商品名)

40 以上を均一に混合して乳剤とする。

【0133】 〔配合例3〕 懸濁剤 (フロアブル剤)

本発明化合物No. 2 アグリゾールS-710 10部

(非イオン性界面活性剤: 花王(株) 商品名) ルノックス1000C 0.5部

(アニオン性界面活性剤: 東邦化学工業(株)商品名)

キサンタンガム 0.2部

64.3部 以上を均一に混合した後、湿式粉砕して懸濁剤とする。

50 [0134]

〔配合例4〕顆粒水和剤(ドライフロアブル剤) 本発明化合物No.2 75部 ハイテノールNE-15 5部 (アニオン性界面活性剤:第一工業製薬(株)商品名) バニレックスN 10部 (アニオン性界面活性剤:日本製紙(株)商品名) カープレックス#80D 10部 (合成含水珪酸:塩野義製薬(株)商品名)

以上を均一に混合粉砕した後、少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して顆粒水和剤とす 10 る。

【0135】 (配合例5) 粒 剤

本発明化合物No.2 ベントナイト

タルク 45部 以上を均一に混合粉砕した後、少量の水を加えて攪拌混

合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤とする。 【0136】〔配合例6〕粉 剤

本発明化合物No. 2

3部

5部

50部

カープレックス#80D

0.5部

(合成含水珪酸: 塩野義製薬(株) 商品名)

カオリナイト

95部

リン酸ジイソプロピル

1.5部

以上を均一に混合粉砕して粉剤とする。

【0137】使用に際しては上記水和剤、乳剤、フロアブル剤、顆粒水和剤は水で50~2000倍に希釈して有効成分が1ヘクタール(ha)当たり0.005~50kgになるように散布する。

[0138]

【実施例】以下に本発明化合物の合成例、製剤例、試験 30 例を実施例として具体的に述べるが、本発明はこれらによって限定されるものではない。

【0139】 (合成例1)3-(1,4-ジメチルピラゾール-5-イル)-3-ヒドロキシ-2-(1-メチル-3-フェニル-1,2,4-トリアゾール-5-イル)-アクリロニトリル (化合物No.1)の合成

5-シアノメチル-1-メチル-3-フェニル-1.2.4-トリアゾール0.5g及び1, 4-ジメチルピラゾール-5-カルボニルクロライド0.48gをテトラヒドロフラン50m1に溶解し、米冷化にてターシャリーブトキシカリウム0.71gを 40加えた。室温で一晩撹拌した後、減圧下で溶媒を留去して得られた油状物を水50m1に溶解し、トルエンで洗浄、水層を濃塩酸で酸性とし、酢酸エチルで抽出、水洗、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を減圧下で留去して得られた固体をイソプロピルエーテルで洗浄し、 標記目的化合物0.46gを得た。融点:188-191℃

【0140】(合成例2)3-(1,4-ジメチルピラゾール-5-イル)-(1-メチル-3-フェニル-1,2,4-トリアゾール-5-イル)-3-ピバロイルオキシアクリロニトリル(化合物No.2)の合成

28

3-(1,4-ジメチルピラゾール-5-イル)-3-ヒドロキシ-2-(1-メチル-3-フェニル-1,2,4-トリアゾール-5-イル)-アクリロニトリル0.3gをクロロホルム50mlに溶解し、トリエチルアミン0.09gを加えて氷冷し、ビバロイルクロライド0.11gを滴下した。室温で一晩撹拌した。反応混合物を水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下で溶媒を留去して得られた租生成物をシリカゲルクロマトグラフィー(クロロホルム/酢酸エチル=3/1)で精製して標記目的化合物0.21g(E体とZ体の3/2混合物)を得た。融点:130-133℃

【0141】前記スキームあるいは上記合成例に準じて 合成した本発明化合物の構造と融点を第2表に示すが、 特に記載のないものはE体とZ体の混合物である。な お、表中の略号は前記と同じ意味を表す。

【0142】〔第2表〕

[0143]

【化5】

20

[0144]

【表5】

H p.	Α	R*	r"	R*	R.	R*	融点(な)、異性体比
1	Ph	¥.	н	1.		н	188-191°C
ŧ	Ph	¥.	00 tBu	v.	¥.	н	130-130%, 3 / 1
3	Ph	H.	н	Re-	н	He	206-208°C
4	Ph	že.	CO tBu	H.	н	ii.	樹厚菜、3 / 2
5	Ph		н		CI	No.	159-161°C
£	Ph	H.	00 tBu		CI	. He	祖章表、3/1
7	Ph		н	i.	CI	Et	1 79- 18 2°C
	Ph		CO t Bu	ı,	CI	Et	153-156℃、E体またはZ体
9	Ph	H.	н	ı.	V.	¥e.	166-169℃
10	Ph	He.	CO tBu	¥.		¥e	祖群党、1/1
11	Ph		н	ŧ.	020	No.	144-150°C
12	Ph	Bq.	O) tBu	H.	O No	Шe	129-132℃、3 / 1
13	Ph	nH ex	н	¥.	#+	ž.	85 -88°C
14	Ph	nHex	CO tBu	4.	H.	ii.	樹彦改、5 / 1

【0145】〔試験例〕次に、本発明化合物の有害生物 防除剤としての有用性について、以下の試験例において 具体的に説明する。尚、対照化合物として下記の化合物 Aおよび化合物Bを用いた。化合物AはWD98/42683公報第2 表記載の化合物No.2-1であり、化合物BはWD/42683公報 第4表の化合物No.4-1からの誘導体である。

[0146]

【化6】

50

[0147]

【試験例1】 ナミハダニ幼虫に対する殺虫試験インゲンの葉をリーフパンチを用いて径3.0cmの円形に切り取り、径7cmのスチロールカップ上の湿った戸紙上に置いた。これにナミハダニ幼虫を1葉当たり10頭接種した。明細書に記載された本発明化合物及び対照化合物Aの5%乳剤(化合物によっては25%水和剤を供試)を展着剤の入った水で希釈して100ppm濃度に調整し、この薬液をスチロールカップ当たり2mlづつ回転式散布塔用いて散布し、25℃の恒温室に収容し、96時間10経過後の死虫率を下記の計算式から求めた。尚、試験は2区制でおこなった。

29

[0148]

【数1】

死虫率= {死虫数/(死虫数+生存虫数)} ×100 【0149】その結果、以下の化合物が80%以上の死虫率を示した。

化合物No.: 2, 4, 5, 6, 9, 10, 13, 1

一方、対照に用いた化合物Aは100ppm濃度でなんら効果 20 を示さなかった。

[0150]

〔試験例2〕 ナミハダニ雌成虫に対する殺虫試験 インゲンの葉をリーフパンチを用いて径3.0cmの円形 に切り取り、径7cmのスチロールカップ上の湿った沪 紙上に置いた。これにナミハダニ雌成虫を1葉当たり1 の頭接種した。本発明化合物No.14及び対照化合物Bの5 %乳剤を展着剤の入った水で希釈して1.6~50ppm濃度に 調整し、この薬液をスチロールカップ当たり2m1づつ 回転式散布塔用いて散布し、25℃の恒温室に収容し、48 時間経過後の死虫率を試験例1の計算式から求めた。 尚、試験は2区制でおこなった。結果を第3表に示す。 【0151】

【表6】

(第3表)

有効成分濃度	死虫率(%)				
(ppm)	化合物No. 1 4	化合物B			
5 0	100	9 0			
2 5	100	5 0			
12, 5	9 0	10			
6. 3	9 5	0			
3. 1	4 0				
1.6	5				

[0152]

【発明の効果】本発明の化合物は、優れた有害生物防除 活性を示す。

## フロントページの続き

(72)発明者 三宅 敏郎

埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470 日産 化学工業株式会社生物科学研究所内

(72)発明者 瀧井 新自

埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470 日産 化学工業株式会社生物科学研究所内 (72)発明者 伊藤 俊紀

埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470 日産 化学工業株式会社生物科学研究所内

Fターム(参考) 4C063 AA01 AA03 BB04 CC41 CC78 DD12 DD22 EE03

4H011 AC02 AC04 BB09 DA02 DA15

DA16 DD03